

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
15. Juli 2004 (15.07.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/058247 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/381,
9/70

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/014902

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Dezember 2003 (24.12.2003)

(25) Elnreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 61 696.5 30. Dezember 2002 (30.12.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): SCHWARZ-PHARMA AG [DE/DE]; Al-
fred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BREITENBACH,
Armin [DE/DE]; Opladener Strasse 108, 40789 Monheim
(DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: SCHWARZ-PHARMA AG;
z.Hd. Herrn D.W. Schacht, Alfred-Nobel-Strasse 10,
40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,
RU, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: DEVICE FOR THE TRANSDERMAL ADMINISTRATION OF A ROTIGOTINE BASE

(54) Bezeichnung: VORRICHTUNG ZUR TRANSDERMALEN VERABREICHUNG VON ROTIGOTIN-BASE

(57) Abstract: The invention relates to a polymer matrix suitable for the transdermal administration of rotigotine [(-)-5, 6, 7, 8-tetrahydro-6-[propyl[2-(2-thienyl)ethyl]amino]-1-naphthol], containing a matrix for the transdermal administration of rotigotine [(-)-5, 6, 7, 8-tetrahydro-6-[propyl[2-(2-thienyl)ethyl]amino]-1-naphthol], containing a matrix polymer which is supersaturated with a rotigotine base. Said polymer matrix is characterised in that the part of the rotigotine which is not dissolved in the matrix polymer is dispersed in the matrix polymer as amorphous particles having a maximum mean diameter of 30 µm, and the matrix is free of solubilisers, crystallisation inhibitors and dispersants. The invention also relates to a flat device for the transdermal administration of rotigotine, containing the above-mentioned, preferably silicon-based polymer matrix which is supersaturated with rotigotine, and a rear layer which is impermeable to the active ingredient.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft eine zur transdermalen Verabreichung von Rotigotin [(-)-5, 6, 7, 8-Tetrahydro-6-[propyl[2-(2-thienyl)ethyl]amino]-1-naphthol] geeignete Polymermatrix, enthaltend Matrix zur transdermalen Verabreichung von Rotigotin [(-)-5, 6, 7, 8-Tetrahydro-6-[propyl[2-(2-thienyl)ethyl]amino]-1-naphthol], enthaltend ein mit Rotigotin-Base übersättigtes Matrixpolymer, dadurch gekennzeichnet, dass der nicht im Matrixpolymer gelöste Anteil des Rotigotins als amorphe Partikel mit einem mittleren Durchmesser von maximal 30 µm im Matrixpolymer dispergiert ist und die Matrix frei von Löslichkeitsvermittlern, Kristallisationsinhibitoren und Dispersionsmitteln ist. Ferner betrifft die Erfindung eine flächenförmige Vorrichtung zur transdermalen Verabreichung von Rotigotin, die die oben beschrieben, mit Rotigotin übersättigte, vorzugsweise silikonbasierte Polymermatrix und eine für den Wirkstoff undurchlässige Rückschicht enthält.

WO 2004/058247 A1